

特 許 協 力 条 約

PCT

REC'D 17 JUN 2004

WIFO

PCT

特許性に関する国際予備報告 (特許協力条約第二章)

(法第12条、法施行規則第56条)

[PCT36条及びPCT規則70]

出願人又は代理人 の書類記号 Y0360-PCT	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP03/14065	国際出願日 (日.月.年) 04.11.2003	優先日 (日.月.年) 07.11.2002
国際特許分類 (IPC) Int. Cl ⁷ A61K31/426, A61P13/10, 13/00 // C07D277/40		
出願人 (氏名又は名称) 山之内製薬株式会社		

<p>1. この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。 法施行規則第57条 (PCT36条) の規定に従い送付する。</p> <p>2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で <u>4</u> ページからなる。</p> <p>3. この報告には次の附属物件も添付されている。</p> <p>a <input type="checkbox"/> 附属書類は全部で _____ ページである。</p> <p><input type="checkbox"/> 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙 (PCT規則70.16及び実施細則第607号参照)</p> <p><input type="checkbox"/> 第I欄4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙</p> <p>b <input type="checkbox"/> 電子媒体は全部で _____ (電子媒体の種類、数を示す)。 配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。 (実施細則第802号参照)</p> <p>4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第I欄 国際予備審査報告の基礎</p> <p><input type="checkbox"/> 第II欄 優先権</p> <p><input type="checkbox"/> 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成</p> <p><input type="checkbox"/> 第IV欄 発明の単一性の欠如</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明</p> <p><input type="checkbox"/> 第VI欄 ある種の引用文献</p> <p><input type="checkbox"/> 第VII欄 国際出願の不備</p> <p><input type="checkbox"/> 第VIII欄 国際出願に対する意見</p>	
---	--

国際予備審査の請求書を受理した日 24.02.2004	国際予備審査報告を作成した日 26.05.2004	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 守安 智	4P 8519
電話番号 03-3581-1101 内線 3452		

様式PCT/IPEA/409 (表紙) (2004年1月)

第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、_____語による翻訳文を基礎とした。

それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

- ☐ PCT規則12.3及び23.1(b)という国際調査
☐ PCT規則12.4という国際公開
☐ PCT規則55.2又は55.3という国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第_____ページ、 出願時に提出されたもの
 第_____ページ*、
 第_____ページ*、

付で国際予備審査機関が受理したもの
 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第_____項、 出願時に提出されたもの
 第_____項*、 PCT19条の規定に基づき補正されたもの
 第_____項*、
 第_____項*、

付で国際予備審査機関が受理したもの
 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第_____ページ/図、 出願時に提出されたもの
 第_____ページ/図*、
 第_____ページ/図*、

付で国際予備審査機関が受理したもの
 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第_____ページ
☐ 請求の範囲 第_____項
☐ 図面 第_____ページ/図
☐ 配列表(具体的に記載すること)
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること)

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

- ☐ 明細書 第_____ページ
☐ 請求の範囲 第_____項
☐ 図面 第_____ページ/図
☐ 配列表(具体的に記載すること)
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること)

* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条（PCT35条(2)）に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性 (N)

請求の範囲	1-10	有
請求の範囲		無

進歩性 (IS)

請求の範囲	1-10	有
請求の範囲		無

産業上の利用可能性 (IA)

請求の範囲	1-10	有
請求の範囲		無

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

- 文献1: GB 2356197 A (Merck & Co., Inc.) 2001.05.16
 文献2: WO 99/20607 A1 (山之内製薬株式会社) 1999.04.29
 文献3: WO 02/00622 A2 (Fujisawa Pharmaceutical Co., Ltd.) 2002.01.03
 文献4: WO 01/062705 A2 (Fujisawa Pharmaceutical Co., Ltd.) 2001.08.30
 文献5: JP 2001-114736 A (キッセイ薬品工業株式会社) 2001.04.24
 文献6: WO 00/002846 A1 (キッセイ薬品工業株式会社) 2000.01.20
 文献7: 森田隆, 他, 『膀胱および外尿道括約筋における β_3 受容体の存在とその機能』, 日本泌尿器科学会雑誌 88(2) p119(p183) (1997)
 文献8: 井川靖彦, 他, 『ヒト排尿筋における β_3 -アドレナリン受容体機能の薬理的および分子生物学的解明』, 日本泌尿器科学会雑誌 88(2) p119(p183) (1997)

文献1及び2には、本国際出願に記載の発明における有効成分の化合物が、 β_3 アドレナリン受容体アゴニストであることが示されている。

文献3及び4には、 β_3 アドレナリン受容体アゴニストが、抗尿失禁、抗頻尿活性を有することが記載されている (DISCLOSURE OF INVENTIONの項)。

文献5及び6には、ヒト膀胱に β_3 -アドレナリン受容体が存在し、 β_3 アドレナリン受容体刺激薬によりヒトの膀胱が弛緩すること; β_3 -アドレナリン受容体刺激薬は、頻尿、尿失禁等の予防または治療剤としての有用性が見出されていることが記載されている (文献5: 段落番号【0007】～【0009】、文献6: 「背景技術」の項)。

文献7、8には、膀胱に β_3 アドレナリン受容体が存在すること; β_3 アドレナリン受容体アゴニストは、膀胱弛緩作用を有し、尿失禁に効果を有するであろうことが記載されている。

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 V 欄の続き

* 請求の範囲: 1-10

請求の範囲第1項～第10項に記載の発明は、国際調査報告で引用された文献1～8に対し進歩性を有する。

本願は、「過活動膀胱の治療剤」に係るものであるが、「尿失禁の治療剤」、「頻尿の治療剤」などと実質的な差異があるものとは認めることができない。この点で、 β_3 アドレナリン受容体アゴニスト、作用物質は膀胱弛緩作用を有し、抗尿失禁、抗頻尿活性などに使用されることが知られている(文献3～8)から、そのような化合物を「過活動膀胱の治療剤」として使用すること自体には格別の創意を要するものとは認めることができない。しかしながら、本願の有効成分である(R)-2-(2-アミノチアゾール-4'-[2-[(2-ヒドロキシ-2-フェニルエチル)アミノ]エチル]酢酸アニリド(のフリー体、塩)は、 β_3 アドレナリン受容体アゴニスト、作用物質であることは文献1～2で明らかであるが、当該化合物は代表的な β_3 アドレナリン受容体アゴニスト、作用物質であるCGP-12177Aよりも270倍以上の活性を奏するものであるから、斯かる成分よりなる「過活動膀胱の治療剤」は従来の技術水準と比較して予想外の効果を奏するものと認められる。